



Europäisches Patentamt

European Patent Office

Office européen des brevets

(11) Veröffentlichungsnummer:

0 136 976

A2

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 84810408.9

(51) Int. Cl.⁴: A 01 N 43/54

(22) Anmeldetag: 20.08.84

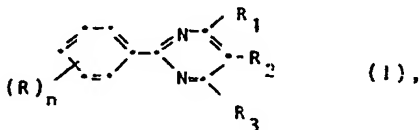
(30) Priorität: 23.08.83 CH 4614/83

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:
10.04.85 Patentblatt 85/15(84) Benannte Vertragsstaaten:
BE CH DE FR GB IT LI NL(71) Anmelder: CIBA-GEIGY AG
Postfach
CH-4002 Basel(CH)(72) Erfinder: Seiler, Alfred, Dr.
Schulstrasse 14
CH-4332 Stein(CH)(72) Erfinder: Müller, Urs, Dr.
Drosselstrasse 6
CH-4142 Münchenstein(CH)

(54) Verwendung von Phenylpyrimidinen als Pflanzenregulatoren.

(57) Phenylpyrimidine der unten definierten Formel I eignen sich zur Regulierung des Pflanzenwuchses. Sie können für verschiedene Zwecke verwendet werden wie z.B. Massnahmen die mit der Ertragssteigerung von Nutzpflanzen, Ernteerleichterung und Arbeitseinsparung ferner Erhöhung der Knick- und Wetterfestigkeit der Pflanzen im Zusammenhang stehen. Die Phenylpyrimidine entsprechen der Formel I

R₂ Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl oder Phenyl bedeuten.



worin R Wasserstoff, Halogen, Nitro Cyan gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Hydroxy gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Sulfhydryl, Alkylthio, Carboxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Amino, Alkylamino, Acetylamino, Ureido, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Sulfamoyl, Alkylsulfamoyl oder Alkoxyphosphonylmethyl

R₁ und R₃ unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Cyan, Hydroxy, Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alkoxycarbonyloxy, Amino, Alkylamino, Morpholino oder Sulfhydryl und

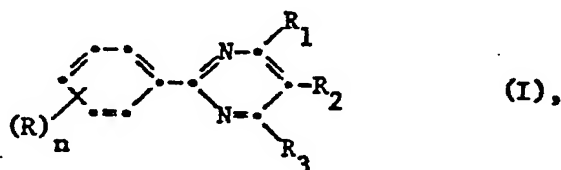
CIBA-GEIGY AG
Basel (Schweiz)

5-14556/="

Verwendung von Phenylpyrimidinen als Pflanzenregulatoren

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Regulierung des Pflanzenwachstums mittels Phenylpyrimidinen sowie die Verwendung dieser Substanzen zur Steuerung physiologischer Vorgänge im Pflanzenmetabolismus.

Die Phenylpyrimidine entsprechen der Formel I



worin

n eine Zahl von 1 bis 5,

R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, $-XR_5$, $-NR_6R_7$, $-CO-A$, $-CS-NR_6R_7$, $-SO_2-NR_6R_7$, $C(OR_4)_2-R_4$, $\begin{array}{c} -C-R_4 \\ \diagup \quad \diagdown \\ O \quad O \\ \diagdown \quad \diagup \\ B \end{array}$, $-PO(OR_4)_2$, $-SO_3H$, $-N=CR_8R_9$, eine

unsubstituierte oder durch Halogen, $-XR_5$, $-NR_6R_7$, $-PO(OR_4)_2$, $-CO-A$ oder Cyan substituierte C_1-C_6 -Alkyl- oder C_3-C_6 -Cycloalkylgruppe oder eine unsubstituierte oder durch Halogen oder $-XR_4$ substituierte C_2-C_6 -Alkenyl-, C_3-C_6 -Cycloalkyl- oder C_3-C_6 -Alkinylgruppe,

R_1 und R_3 unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, Cyan, $-CO-A$, $-NR_6R_7$, $-XR_5$ oder unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, Nitro oder $-XR_5$ substituiertes Phenyl,

R_2 Wasserstoff, Halogen, unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, Trifluormethyl, Nitro oder $-XR_5$ substituiertes Phenyl oder

eine unsubstituierte oder durch Halogen oder $-XR_5$ substituierte C_1-C_6 -Alkyl-, C_3-C_6 -Cycloalkyl-, C_2-C_6 -Alkenyl- oder C_2-C_6 -Alkynylgruppe,

R_4 Wasserstoff, eine unsubstituierte oder durch Halogen, $-CO-A$, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy oder $-NR_6R_7$ substituierte C_1-C_6 -Alkyl- oder C_3-C_6 -Alkenyl- oder C_2-C_6 -Alkynylgruppe,

R_5 dasselbe wie R_4 , ausserdem C_1-C_6 -Alkylcarbonyl, C_3-C_6 -Alkenylcarbonyl, C_3-C_6 -Alkynylcarbonyl,

R_6 und R_7 unabhängig voneinander je Wasserstoff, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder unsubstituiertes oder durch $-CO-A$ substituiertes C_1-C_6 Alkyl, oder einer der Reste R_6 und R_7 bedeutet eine Gruppe $-COA$ oder $-OR_4$ oder

R_6 und R_7 zusammen eine 4- bis 6-gliedrige Alkylenkette, die durch Sauerstoff, Schwefel, eine Imino- oder C_1-C_4 -Alkylaminogruppe unterbrochen sein kann,

B eine verzweigte oder unverzweigte C_1-C_6 -Alkylenkette und

X Sauerstoff, Schwefel, $-SO-$ oder $-SO_2-$ bedeuten,

A die gleiche Bedeutung wie R_4 hat oder für $-OR_4$ oder $-NR_6R_7$ steht,

R_8 unsubstituiertes oder durch C_1-C_6 -Alkoxy substituiertes Alkyl,

R_9 Wasserstoff oder dasselbe wie R_8 oder

R_8 und R_9 zusammen eine 4-5-gliedrige Alkylenkette bedeuten.

Solche Phenylpyrimidine und ihre Verwendung zur Antagonisierung der phytotoxischen Wirkung von Herbiziden auf Kulturpflanzen sind in der EP-A-55 693 beschrieben worden.

Es wurde nun Überraschend gefunden, dass die Wirkstoffe der Formel I bzw. Mittel, die diese Wirkstoffe enthalten, sich vor allem dadurch auszeichnen, dass sie gezielt in den Metabolismus der Pflanzen eingreifen. Dieser gezielte Eingriff in die physiologischen Vorgänge der Pflanzenentwicklung macht die Wirkstoffe der Formel I für verschiedene Zwecke verwendbar, insbesondere für solche, die

mit der Ertragssteigerung bei Nutzpflanzen, der Ernteerleichterung und der Arbeitseinsparung bei Massnahmen an Pflanzenkulturen im Zusammenhang stehen.

Für die Wirkungsweise von Pflanzenwachstumsregulatoren gilt nach der bisherigen Erfahrung, dass ein Wirkstoff eine oder auch mehrere verschiedenartige Wirkungen auf Pflanzen ausüben kann. Die Wirkungen der Stoffe hängen im wesentlichen ab von dem Zeitpunkt der Anwendung, bezogen auf das Entwicklungsstadium des Samens oder der Pflanze sowie von den auf die Pflanzen oder ihre Umgebung ausgebrachten Wirkstoffmengen und von der Art der Applikation. In jedem Fall sollen Wachstumsregulatoren die Kulturpflanzen in gewünschter Weise positiv beeinflussen.

Pflanzenwuchsregulierende Stoffe können zum Beispiel zur Hemmung des vegetativen Pflanzenwachstums eingesetzt werden. Eine derartige Wuchshemmung ist unter anderem bei Gräsern von wirtschaftlichem Interesse, denn dadurch kann z.B. die Häufigkeit der Grasschnitte in Ziergärten, Park- und Sportanlagen oder an Strassenrändern reduziert werden. Von Bedeutung ist auch die Hemmung des Wuchses von krautigen und holzigen Pflanzen an Strassenrändern und in der Nähe von Ueberlandleitungen oder ganz allgemein in Bereichen, in denen ein starker Bewuchs unerwünscht ist.

Wichtig ist auch die Anwendung von Wachstumsregulatoren zur Hemmung des Längenwachstums bei Getreide, denn durch eine Halmverkürzung wird die Gefahr des Umknickens ("Lagerns") der Pflanzen vor der Ernte verringert oder vollkommen beseitigt. Ausserdem können Wachstumsregulatoren bei Getreide eine Halmverstärkung hervorrufen, die ebenfalls dem Lagern entgegenwirkt.

Eine Hemmung des vegetativen Wachstums erlaubt bei vielen Kulturpflanzen eine dichtere Anpflanzung der Kultur, so dass ein Mehrertrag, bezogen auf die Bodenfläche, erzielt werden kann.

Ein weiterer Mechanismus der Ertragssteigerung mit Wachstumsheemmern beruht darauf, dass die Nährstoffe in stärkerer Masse der Blüten- und Fruchtbildung zugute kommen, während das vegetative Wachstum eingeschränkt wird.

Mit Wachstumsregulatoren lässt sich häufig auch eine Förderung des vegetativen Wachstums erzielen. Dies ist von grossem Nutzen, wenn die vegetativen Pflanzenteile geerntet werden. Eine Förderung des vegetativen Wachstums kann aber auch gleichzeitig zu einer Förderung des generativen Wachstums führen, so dass z.B. mehr oder grössere Früchte zur Ausbildung kommen.

Ertragssteigerungen können in manchen Fällen auch durch einen Eingriff in den pflanzlichen Stoffwechsel, wie z.B. durch Erhöhung der Photosyntheseleistung, erreicht werden, ohne dass sich Änderungen des vegetativen Wachstums bemerkbar machen. Wachstumsregulatoren können ferner eine Veränderung der Zusammensetzung der Pflanzen bewirken, so dass eine bessere Qualität der Ernteprodukte herbeigeführt wird. So ist es beispielsweise möglich, den Gehalt an Zucker in Zuckerrüben, Zuckerrohr, Ananas sowie Zitrusfrüchten zu erhöhen oder den Proteingehalt in Soja oder Getreide zu steigern.

Unter dem Einfluss von Wachstumsregulatoren kann es zur Ausbildung parthenokarper Früchte kommen. Ferner kann das Geschlecht der Blüten beeinflusst werden.

Mit Wachstumsregulatoren lässt sich auch die Produktion oder der Abfluss von sekundären Pflanzenstoffen positiv beeinflussen. Als Beispiel sei die Stimulierung des Latexflusses bei Gummibäumen genannt.

Während des Wachstums der Pflanze kann durch Einsatz von Wachstumsregulatoren auch die seitliche Verzweigung durch eine chemische Brechung der Apikaldominanz vermehrt werden. Daran besteht z.B. Interesse bei der Stecklingsvermehrung von Pflanzen. Es ist jedoch auch möglich, das Wachstum der Seitentriebe zu hemmen, z.B. um bei Tabakpflanzen nach der Dekapitierung die Ausbildung von Seitentrieben zu verhindern und damit das Blattwachstum zu fördern.

Durch Einsatz von Wachstumsregulatoren lässt sich der vorzeitige Fruchtfall verhindern. Es ist jedoch auch möglich, den Fruchtfall, - zum Beispiel bei Obst -, im Sinne einer chemischen Ausdünnung bis zu einem bestimmten Ausmass zu fördern. Wachstumsregulatoren können auch dazu dienen, um bei Kulturpflanzen zum Zeitpunkt der Ernte die zum Ablösen der Früchte erforderliche Kraft zu vermindern, so dass eine mechanische Beerntung der Pflanzen ermöglicht, beziehungsweise eine manuelle Beerntung erleichtert wird.

Mit Wachstumsregulatoren lässt sich ferner eine Beschleunigung oder auch eine Verzögerung der Reife des Erntegutes vor oder nach der Ernte erreichen. Dieses ist von besonderem Vorteil, weil sich dadurch eine optimale Anpassung an die Bedürfnisse des Marktes herbeiführen lässt. Weiterhin können Wachstumsregulatoren in manchen Fällen die Fruchtausfärbung verbessern. Darüberhinaus kann mit Hilfe von Wachstumsregulatoren auch eine zeitliche Konzentrierung der Reife erzielt werden. Damit werden Voraussetzungen dafür geschaffen, dass z.B. bei Tabak, Tomaten oder Kaffee, eine vollständige mechanische oder manuelle Beerntung in nur einem Arbeitsgang vorgenommen werden kann.

Durch die Anwendung von Wachstumsregulatoren kann auch die Samen- oder Knospenruhe der Pflanzen, also die endogene Jahresrhythmik, beeinflusst werden, so dass die Pflanzen, wie z.B. Ananas oder Zier-

pflanzen in Gärtnereien, zu einem Zeitpunkt keimen, austreiben oder blühen, an dem sie normalerweise hierzu keine Bereitschaft zeigen.

Mit Wachstumsregulatoren kann auch erreicht werden, dass der Austrieb von Knospen oder die Keimung von Samen verzögert wird, z.B. um in frostgefährdeten Gebieten eine Schädigung durch Spätfröste zu vermeiden. Andererseits gelingt es, das Wurzelwachstum zu und/oder die Ausbildung von Sprösslingen zu stimulieren, so dass das Wachstum auf eine kürzere Zeitdauer beschränkt werden kann.

Ferner kann ein grösseres, besser ausgebildetes und tieferes Wurzelwerk eine verbesserte Stressüberwindung (bei Kälte und Trockenheit), eine bessere Ausnützung der Bodennährstoffe, und eine verstärkte Konkurrenzkraft gegenüber den Unkräutern bewirken und so zur Ertragssteigerung führen.

Mit Wachstumsregulatoren kann auch die Samenkeimung unter suboptimalen Bedingungen (z.B. Kälte) gefördert werden. Dies ermöglicht eine frühere Aussaat der Kultur, eine bessere Etablierung unter suboptimalen Bedingungen und kann so zur Ertragssteigerung beitragen.

Wachstumsregulatoren können auch eine Halophilie bei den Kulturpflanzen erzeugen. Damit werden die Voraussetzungen dafür geschaffen, dass eine Kultivierung von Pflanzen auf salzhaltigen Böden durchgeführt werden kann.

Mit Wachstumsregulatoren kann auch eine Frost- und Trockenresistenz bei Pflanzen induziert werden.

Unter dem Einfluss von Wachstumsregulatoren kann das Altern (die Seneszenz) von Pflanzen oder Pflanzenteilen gehemmt respektive verzögert werden. Eine solche Wirkung kann von hohem wirtschaftlichem

Interesse sein, dadurch, dass bei behandelten Pflanzenteilen oder ganzen Pflanzen wie Obst, Beeren, Gemüse, Salat oder Zierpflanzen deren Lagerfähigkeit nach der Ernte verbessert oder verlängert werden kann. Ebenso kann durch Behandlung von Kulturpflanzen über eine Verlängerung der Phase photosynthetischer Aktivität eine beachtliche Ertragssteigerung erzielt werden.

Ein weiteres wichtiges Anwendungsgebiet für Wuchshemmer ist deren Einsatz zur Hemmung eines übermässigen Wachstums bei tropischen Bodenbeckungspflanzen, den sogenannten Cover crops. In tropischen und subtropischen Monokulturen, wie z.B. in Palmpflanzungen, Baumwoll-, Maisfeldern usw. werden neben den eigentlichen Kulturpflanzen oftmals Bodenbedeckungspflanzen, insbesondere Leguminosenarten angepflanzt, die zur Erhaltung oder Steigerung der Bodenqualität (Verhinderung der Austrocknung, Versorgung mit Stickstoff) und zur Verhinderung von Erosion (Abtragung durch Wind und Wasser) dienen. Durch Applikation der erfindungsgemässen Wirkstoffe kann nunmehr das Wachstum dieser Cover crops kontrolliert und somit die Wuchshöhe dieser Bodenbedeckungspflanzen auf einem niedrigen Niveau gehalten werden, so dass ein gesundes Gedeihen der Kulturpflanzen und die Aufrechterhaltung einer günstigen Bodenbeschaffenheit gewährleistet ist.

Die pflanzenregulatorische Wirkung liegt schwerpunktmässig bei der Stimulierung des Wurzelwachstums und der Keimförderung.

Ein verbessertes Wurzelwerk kann zur Ueberwindung von Stressbedingungen, wie Trockenheit, beitragen. Ferner kann dadurch eine bessere Nährstoffaufnahme erwartet werden. In diesem Sinne ist hervorzuheben, dass eine Beeinflussung des Wurzelwertes im positiven Sinne zur Ertragssicherung und Ertragssteigerung beitragen kann.

Die Keimförderung mittels diesen Substanzen unter Stressbedingungen wie Nässe, Kälte usw. kann von Wichtigkeit sein für ein regelmässiges

Auflaufen des Saatgutes unabhängig von Stressfaktoren, kann früheres Aussäen ermöglichen und dadurch eventuell das Ausreifen gewährleisten (Verlängerung der Vegetationszeit), ferner kann dadurch in klimatologischen Randzonen möglicherweise die Kulturfläche ausgedehnt werden. In diesem Sinne ist auch die Keimförderung mittels Chemikalien als ein Mittel zur Ertragssicherung einerseits und andererseits zur Ertragssteigerung zu betrachten.

Besondere Bedeutung haben zur Beeinflussung des Pflanzenmetabolismus diejenigen Phenylpyrimidinen der Formel I erlangt, worin

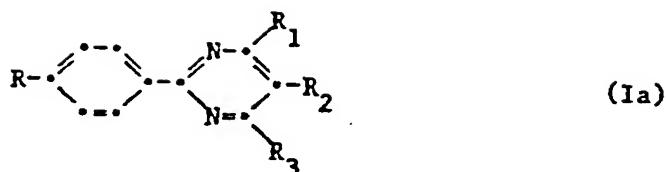
n eine Zahl von 1 bis 3,

R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Cyanoalkyl, Hydroxyl, $(C_1-C_4\text{-Alkoxy})_n$, C_1-C_4 -Halogenalkoxy, C_2-C_8 -Halogenalkoxyalkyl, C_2-C_4 -Alkenyl, C_2-C_4 -Halogenalkenyl, C_2-C_4 -Alkenyloxy, C_2-C_4 -Alkinyl, Sulfhydryl, C_1-C_4 -Alkylthio, Carboxyl, C_1-C_4 -Alkylcarbonyl, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl, C_2-C_4 -Alkenylcarbonyl, C_2-C_4 -Alkinylcarbonyl, C_1-C_4 -Alkylcarbonyl- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -Alkylcarbonyloxy, C_1-C_4 -Alkylaminocarbonyl, C_1-C_4 -Dialkylaminocarbonyl, Amino, C_1-C_4 -Alkylamino, C_1-C_4 -Dialkylamino, Acetyl-amino, Chloracetyl-amino, Methylureido, Dimethylureido, Sulfonyl, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl, Sulfamoyl, C_1-C_4 -Alkylsulfamoyl, C_1-C_4 -Dialkylsulfamoyl, C_1-C_4 -Alkoxy-carbonylsulfamoyl, C_1-C_4 -Dialkoxyphosphonylmethyl

R_1 und R_3 unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, Cyan, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_8 -Alkoxyalkyl, Phenyl, Phenoxy, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyloxy, Amino, C_1-C_4 -Alkylamino, C_1-C_4 -Dialkylamino, Morpholino, Sulfhydryl und

R_3 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl oder Phenyl bedeuten.

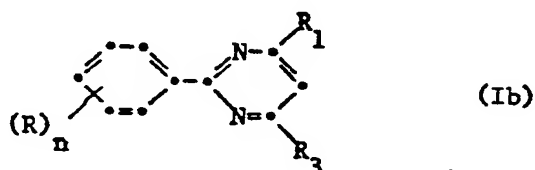
Als besonders geeignete Wuchsregulatoren haben sich die 2-Phenylpyrimidine der Formel Ia erwiesen, worin



worin R Wasserstoff oder Methyl

R_1 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_8 -Alkoxyalkyl, Phenyl, Phenoxy, C_1-C_4 -Alkoxy-carbonyloxy, Amino, C_1-C_4 -Alkylamino, C_1-C_4 -Dialkylamino, Morpholino oder Sulfhydryl,
 R_2 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl oder Phenyl,
 R_3 Halogen, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_8 -Alkoxyalkyl, Phenoxy oder Sulfhydryl bedeuten.

Ebenfalls ausgezeichnete Pflanzenwuchsregulatoren sind die 2-Phenylpyrimidine der Formel Ib



worin n, R, R_1 und R_3 die oben gegebene Bedeutung haben.

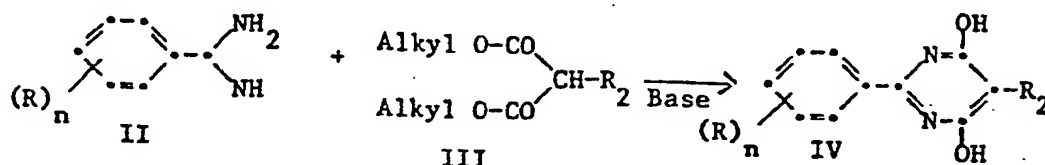
Als Einzelverbindungen sind aufgefallen:

2-Phenyl-4,6-dichlorpyrimidin.

2-(4-Methoxycarbonylamidophenyl)-4,6-dichlorpyrimidin.

Die Phenylpyrimidine der Formel I können durch bekannte Synthesewege hergestellt werden. Der 2-Phenylpyrimidinring wird z.B. durch Kondensation eines Phenylamidins mit einem Malonsäurederivat hergestellt.

Solche 2-Phenylpyrimidine werden beispielsweise dadurch erhalten, dass man in alkoholisch-basischer Lösung ein Phenylamidin mit einem Malonsäuredialkylester kondensiert



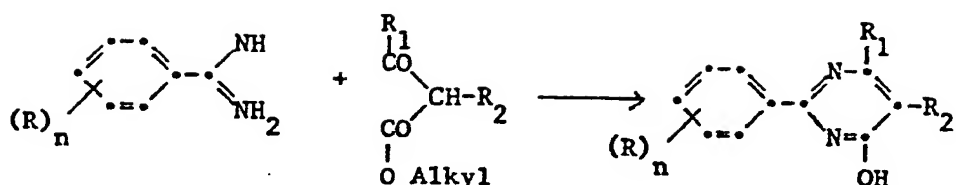
und dann gewünschtenfalls am erhaltenen 2-Phenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin der Formel IV die Hydroxylgruppen mittels Halogenierungsmitteln (Phosphoroxychlorid, Phosphoroxybromid, Sulfurylchlorid, Bromsuccinimid etc.) durch Halogenatome und auch diese gewünschtenfalls durch weitere Reste R_1 und R_3 ersetzt.

Falls R_2 Wasserstoff bedeutet, kann dieses ersetzt werden z.B. durch Einwirkenlassen von Chlor oder Brom in einem polaren Lösungsmittel wie z.B. Eisessig.

Die Halogenatome in den Positionen 4, 5 und 6 des Pyrimidinringes wiederum lassen sich ihrerseits in bekannter Weise durch Alkohole, Mercaptane oder Amine ersetzen.

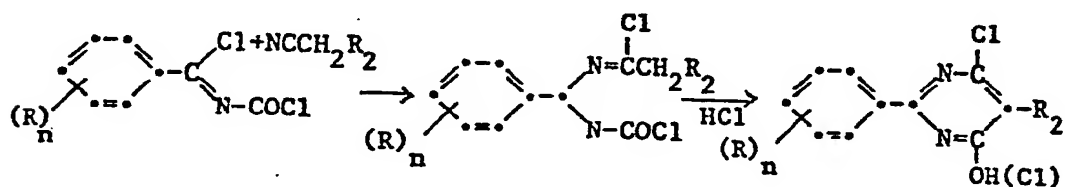
Siehe dazu. z.B. J. Chem. Soc. 1965, S. 5467-5473,
 J.prakt. Chem. 312 (1970), S. 494-506.
 J.chem. Soc. Perkin Trans 1 1977, S. 2285-6.

Phenylpyrimidine, in denen R_1 einen Alkyl- oder Phenylrest bedeuten soll, werden beispielsweise durch Kondensation eines Phenylamidins mit einem Alkylester einer Acetessigsäure erhalten.



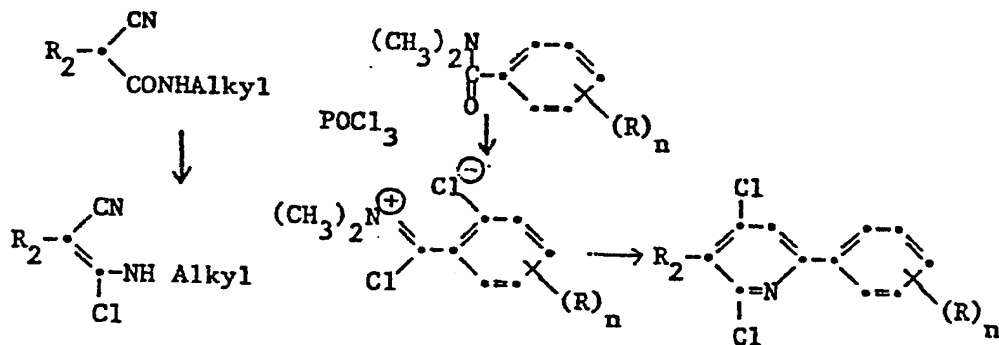
Auch hier kann die -OH Gruppe dann in bekannter Weise durch ein Halogenatom und dieses weiter durch einen Alkohol, Thiol oder ein Amin ersetzt werden.

Ferner gelingt es z.B. auch 2-Phenyl-4,6-dichlorpyrimidin und 2-Phenyl-4-chlor-6-hydroxypyrimidine herzustellen durch Umsetzung von Chlorbenzyliden-carbamoyl-chloride mit einem aliphatischen Nitril in Gegenwart von Chlorwasserstoff



Siehe dazu Bull. Soc. Chem. Japan 44 (1971), S. 2182-2185.

2-Phenyl-4,6-dichlorpyrimidin lässt sich beispielsweise gemäss Ang. Chemie 89 (1977), S. 816-817 beispielsweise durch Kondensation von einem N-Phenylcyanamid und einem N,N-Dialkylamid in $POCl_3$ bei 100° erhalten.



In den obigen Formeln haben R , R_2 und n die in Formel I gegebene Bedeutung.

Die Synthese solcher Verbindungen oder der Austausch von Resten R_1 , R_2 und R_3 durch andere in der Definition gegebene Substituenten ist nicht Bestandteil der Erfindung. Für die Herstellung dieser Verbindungen verweisen wir auf die Beispiele oder auf die Fachliteratur. Siehe dazu auch "The Chemistry of Heterocyclic compounds" 16 Interscience Publishers, New York 1962 Seiten 119 ff.

Die Verbindungen der Formel I können für sich allein oder zusammen mit anderen Wirkstoffen verwendet werden.

Dabei werden Verbindungen der Formel I in unveränderter Form oder vorzugsweise zusammen mit den in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsmitteln eingesetzt und werden daher z.B. zu Emulsionskonzentrationen, direkt versprühbaren oder verdünnbaren Lösungen, verdünnten Emulsionen, Spritzpulvern, löslichen Pulvern, Stäubemitteln, Granulaten, auch Verkapselungen in z.B. polymeren Stoffen in bekannter Weise verarbeitet. Die Anwendungsverfahren wie Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Giessen werden gleich wie die Art der Mittel den angestrebten Zielen und den gegebenen Verhältnissen entsprechend gewählt.

Die Formulierungen, d.h. die den Wirkstoff der Formel I und gegebenenfalls einen festen oder flüssigen Zusatzstoff enthaltenden Mittel, Zubereitungen oder Zusammensetzungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch inniges Vermischen und/oder Vermahlen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, wie z.B. mit Lösungsmitteln, festen Trägerstoffen, und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (Tensiden).

Als Lösungsmittel können in Frage kommen: Aromatische Kohlenwasserstoffe, bevorzugt die Fraktionen C_8 bis C_{12} , wie z.B. Xylolgemische oder substituierte Naphthaline, Phthalsäureester wie Dibutyl- oder Dioctylphthalat, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Cyclohexan oder Paraffine, Alkohole und Glykole sowie deren Aether und Ester, wie

Aethanol, Aethylenglykol, Aethylenglykolmonomethyl- oder äthyläther, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid, sowie gegebenenfalls epoxydierte Pflanzenöle wie epoxydiertes Kokosnussöl oder Sojaöl; oder Wasser.

Als feste Trägerstoffe, z.B. für Stäubemittel und dispergierbare Pulver, werden in der Regel natürliche Gesteinsmehle verwendet, wie Calcit, Talkum, Kaolin, Montmorillonit oder Attapulgit. Zur Verbesserung der physikalischen Eigenschaften können auch hochdisperse Kieselsäure oder hochdisperse saugfähige Polymerisate zugesetzt werden. Als gekörnte, adsorptive Granulatträger kommen poröse Typen, wie z.B. Bimsstein, Ziegelbruch, Sepiolit oder Bentonit, als nicht sorptive Trägermaterialien z.B. Calcit oder Sand in Frage. Darüberhinaus kann eine Vielzahl von vorgranulierten Materialien anorganischer oder organischer Natur wie insbesondere Dolomit oder zerkleinerte Pflanzenrückstände verwendet werden.

Als oberflächenaktive Verbindungen kommen je nach der Art des zu formulierenden Wirkstoffes der Formel I nichtionogene, kation- und/oder anionaktive Tenside mit guten Emulgier-, Dispergier- und Netzeigenschaften in Betracht. Unter Tensiden sind auch Tensidgemische zu verstehen.

Geeignete anionische Tenside können sowohl sog. wasserlösliche Seifen wie wasserlösliche synthetische oberflächenaktive Verbindungen sein.

Als Seifen eignen sich die Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierten Ammoniumsalze von höheren Fettsäuren (C_{10} - C_{22}), wie z.B. die Na- oder K-Salze der Oel- oder Stearinsäure, oder von natürlichen Fettsäuregemischen, die z.B. aus Kokosnuss- oder Talgöl gewonnen werden können. Ferner sind auch die Fettsäure-methyl-aurinsalze zu erwähnen.

Häufiger werden jedoch sog. synthetische Tenside verwendet, insbesondere Fettsulfonate, Fettsulfate, sulsonierte Benzimidazol-derivate oder Alkylarylsulfonate.

Die Fettsulfonate oder -sulfate liegen in der Regel als Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierte Ammoniumsalze vor und weisen einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen auf, wobei Alkyl auch den Alkylteil von Acylresten einschliesst, z.B. das Na- oder Ca-Salz der Ligninsulfonsäure, des Dodecylschwefelsäureesters oder eines aus natürlichen Fettsäuren hergestellten Fettalkoholsulfatgemisches. Hierher gehören auch die Salze der Schwefelsäureester und Sulfonsäuren von Fettalkohol-Aethylenoxid-Addukten. Die sulfonierten Benzimidazol-derivate enthalten vorzugsweise 2 Sulfonsäuregruppen und einen Fettsäurerest mit 8-22 C-Atomen. Alkylarylsulfonate sind z.B. die Na-, Ca- oder Triäthanolaminsalze der Dodecylbenzolsulfonsäure, der Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, oder eines Naphthalinsulfonsäure-Formaldehydkondensationsproduktes.

Ferner kommen auch entsprechende Phosphate, wie z.B. Salze des Phosphorsäureesters eines p-Nonylphenol-(4-14)-Aethylenoxid-Adduktes in Frage.

Als nichtionische Tenside kommen in erster Linie Polyglykoläther-derivate von aliphatischen oder cycloaliphatischen Alkoholen, gesättigten oder ungesättigten Fettsäuren und Alkylphenolen in Frage, die 3 bis 30 Glykoläthergruppen und 8 bis 20 Kohlenstoffatome im (aliphatischen) Kohlenwasserstoffrest und 6 bis 18 Kohlenstoffatome im Alkylrest der Alkylphenole enthalten können.

Weitere geeignete nichtionische Tenside sind die wasserlöslichen, 20 bis 250 Aethylenglykoläthergruppen und 10 bis 100 Propylenglykoläthergruppen enthaltenden Polyäthylenoxidaddukte an Polypropylenglykol, Aethylendiaminopolypropylenglykol und Alkylpolypropylen-

glykol mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen in der Alkylkette. Die genannten Verbindungen enthalten üblicherweise pro Propylenglykol-Einheit 1 bis 5 Äthylenglykoleinheiten.

Als Beispiele nichtionischer Tenside seien Nonylphenolpolyäthoxyäthanoole, Ricinussölpolyglykoläther, Polypropylen-Polyäthylenoxyaddukte, Tributylphenoxypolyäthoxyäthanol, Polyäthylenglykol und Octylphenoxypolyäthoxyäthanol erwähnt.

Ferner kommen auch Fettsäureester von Polyoxyäthylensorbitan wie das Polyoxyäthylensorbitan-trioleat in Betracht.

Bei den kationischen Tensiden handelt es sich vor allem um quartäre Ammoniumsalze, welche als N-Substituenten mindestens einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen enthalten und als weitere Substituenten niedrige, gegebenenfalls halogenierte Alkyl-, Benzyl- oder niedrige Hydroxyalkylreste aufweisen. Die Salze liegen vorzugsweise als Halogenide, Methylsulfate oder Äthylsulfate vor, z.B. das Stearyltrimethylammoniumchlorid oder das Benzyl-di(2-chloräthyl)äthylammoniumbromid.

Die in der Formulierungstechnik gebräuchlichen Tenside sind u.a. in folgenden Publikationen beschrieben:

"Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC
Publishing Corp., Ringwood, New Jersey, 1979.
Sisely and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents",
Chemical Publishing Co., Inc. New York, 1964.

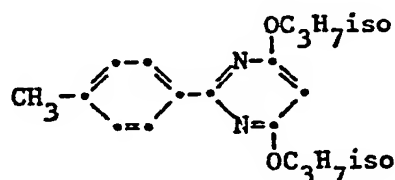
Die pestiziden Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99%, insbesondere 0,1 bis 95%, Wirkstoff der Formel I, 1 bis 99% eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25%, insbesondere 0,1 bis 25%, eines Tensides.

Während als Handelsware eher konzentrierte Mittel bevorzugt werden, verwendet der Endverbraucher in der Regel verdünnte Mittel.

Die Mittel können auch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, Entschäumer, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel, sowie Dünger oder andere Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten.

In den nachfolgenden Beispielen sind die Temperaturen in Celsiusgraden angegeben, Prozente und Angaben von "Teilen" beziehen sich auf das Gewicht.

Beispiel 1: 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropyloxy-pyrimidin



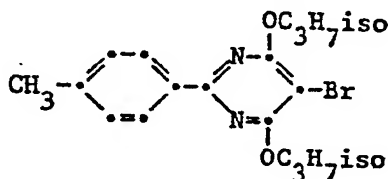
(a) Man löst 21,16 g Natrium in wasserfreiem Isopropanol. In die entstandene Lösung trägt man danach bei 60-65°C innerhalb von 15 Minuten 95,64 g 4,6-Dichlor-2-para-tolyl-pyrimidin ein. Das Gemisch wird anschliessend zum Sieden erhitzt und zur Vervollständigung der Reaktion noch 4 Stunden am Rückfluss weitergekocht. Dann wird der überschüssige Isopropanol abdestilliert und das zurückbleibende Öl in Chloroform aufgenommen. Die Chloroformschicht wird mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und das Lösungsmittel wird abdestilliert. Man erhält so 112 g 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropyloxy-pyrimidin als gelbliches Öl, welches man zwecks Reinigung am Hochvakuum destilliert. Der Siedepunkt beträgt 123°C/5.332 Pascal.

Das als Ausgangsprodukt benötigte 2-para-Tolyl-4,6-dichlor-pyrimidin wird auf folgende Weise hergestellt:

b) 102,3 g p-Tolylamidinhydrochlorid und 99,3 g Malonsäurediäthylester werden in 520 ml wasserfreiem Aethanol angeschlämmt. Unter gutem Rühren und Kühlung lässt man nun 323,7 g einer 30%igen Natrium-methylatlösung einfließen. Danach wird zum Rückfluss erhitzt und 4 bis 5 Stunden am Rückfluss gerührt. Nach Abdestillation des Lösungsmittels wird der Rückstand in 1000 ml Wasser aufgenommen, auf 80°C erhitzt und die etwas trübe Lösung über Kieselsäure filtriert. Nach dem Abkühlen wird mit 15%iger Salzsäure angesäuert. Der dicke Kristallbrei wird abfiltriert, mit Wasser gewaschen und bei 100°C getrocknet. Man erhält 100-110 g 2-para-Tolyl-4,6-Dihydroxypyrimidin, Schmelzpunkt 314°C (Zersetzung).

(c) 72,6 g der Dihydroxy-Verbindung werden mit 72,6 g N,N-Dimethylanilin und 363 g Phosphoroxychlorid zum Sieden erhitzt und eine Stunde am Rückfluss gerührt. Nach Abdestillation des überschüssigen Phosphoroxychlorids wird das zurückbleibende Produkt, zur Entfernung des noch anhaftenden Phosphoroxychlorids, mit Eiswasser behandelt, danach mit Eiswasser fein gemahlen, abfiltriert, mit Eiswasser gewaschen und bei 40-50°C im Vakuum getrocknet. Man erhält so 85,9 g 2-para-Tolyl-4,6-dichloro-pyrimidin vom Schmelzpunkt 86-87°C.

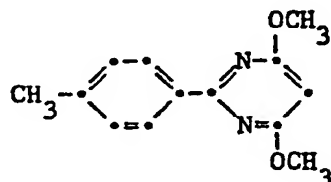
Beispiel 2: 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropoxy-5-brom-pyrimidin



Man erhitzt 111,7 g 4,6-Di-isopropoxy-2-para-tolyl-pyrimidin und 450 ml Tetrachlorkohlenstoff auf 70-75°C. In die entstandene Lösung gibt man 0,5 g Dibenzoylperoxid und anschliessend innerhalb von 45 Minuten ein Gemisch von 1 g Azoisobutyronitril und 70,8 g N-Bromsuccinimid. Zur Vervollständigung der Reaktion wird noch 2 Stunden am Rückfluss erhitzt. Das ausgefallene Succinimid wird dann abfil-

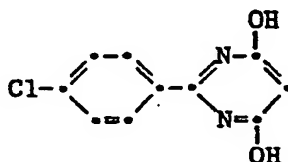
triert und der überschüssige Tetrachlorkohlenstoff abdestilliert. Man erhält 141 g Titelprodukt, welches nach Behandlung mit Methanol zwecks Reinigung, einen Schmelzpunkt von 74-75°C aufweist.

Beispiel 3: 2-para-Tolyl-4,6-dimethoxy-pyrimidin



156,1 g einer 30,5%igen Natriummethylatlösung werden mit 700 ml wasserfreiem Methanol verrührt. In die Lösung werden nun innerhalb von 10 Minuten unter leichter Kühlung 95,64 g 2-para-Tolyl-4,6-dichloro-pyrimidin eingetragen. Danach wird auf Rückfluss erhitzt und 4 Stunden am Sieden gehalten. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wird das zurückbleibende Produkt in 1000 ml Wasser eingetragen. Zur Entfernung des entstandenen Natriumchlorids wird mit Wasser fein gemahlen. Danach abfiltriert, mit Wasser gewaschen und an der Luft getrocknet. Man erhält so 90,4 g Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von 61-62°C.

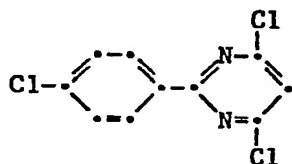
Beispiel 4: 2-para-Chlorphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin



Zu einer Suspension von 38,2 g 4-Chlorbenzylamidin-Hydrochlorid und 33,6 g Malonsäurediäthylester in 175 ml Methanol gibt man innerhalb 10 Minuten 108 g 30%ige Natriummethylat/Methanol-Lösung und kocht anschliessend das Ganze während 5 Stunden am Rückfluss. Dann wird das Lösungsmittel am Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand in 1000 ml heissem Wasser aufgenommen und filtriert. Das Filtrat wird

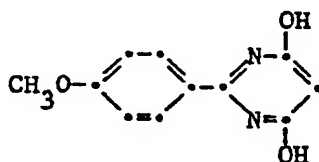
dann auf pH 1 angesäuert, der ausgefallene Niederschlag wird abfiltriert und im Vakuum bei 80°C getrocknet. Man erhält so 44 g 2-para-Chlorphenyl-4,6-dihydroxypyrimidin mit einem Schmelzpunkt von 333°C (Zersetzung).

Beispiel 5: 2-para-Chlorphenyl-4,6-dichlor-pyrimidin



Zu 22 ml N,N-Dimethylanilin tropft man bei Raumtemperatur 50 ml Phosphoroxychlorid (POCl_3), dann werden unter Kühlung, so dass die Temperatur unterhalb 40°C bleibt, 22,3 g 2-para-Chlorphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin portionenweise zugegeben und 2 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, nachher noch 2 Stunden unter Rückfluss gekocht. Das Reaktionsgemisch wird anschliessend am Rotationsverdampfer eingeeengt und der Rückstand mit 500 ml Wasser zerrieben. Das Produkt wird abgenutscht, in Methylenchlorid gelöst, mit Bleicherde behandelt, getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand kristallisiert und ergibt 16,2 g 2-para-Chlorphenyl-4,6-dichlorpyrimidin mit Schmelzpunkt 119-120°C. Eine bei 80°/0,02 mbar sublimierte Probe schmilzt bei 120-121°C.

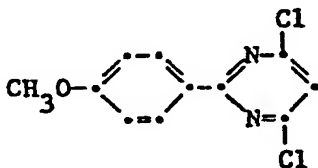
Beispiel 6: 2-para Methoxyphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin



Zu einer Suspension von 112 g para-Methoxybenzamidin-Hydrochlorid und 101 g Malonsäurediäthylester in 520 ml Aethanol werden innerhalb von

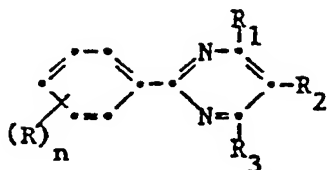
10 Minuten 338 g 30%ige Natriummethylat/Methanol-Lösung gegeben und das Ganze anschliessend während 5 Stunden am Rückfluss gekocht. Das Reaktionsgemisch wird anschliessend am Rotationsverdampfer eingeeengt und der Rückstand in 1000 ml 80°C warmem Wasser gelöst. Man filtriert und säuert das Filtrat bis pH 1 an. Der Niederschlag wird abfiltriert und im Vakuum bei 80°C getrocknet. Man erhält so 109,8 g 2-para-Methoxyphenyl-4,6-dihydroxypyrimidin mit einem Schmelzpunkt von 318°C (Zersetzung).

Beispiel 7: 2-para-Methoxyphenyl-4,6-dichlor-pyrimidin




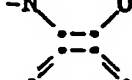








Zu 54,5 g 2-para-Methoxyphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin tropft man unter Kühlen, so dass die Reaktionstemperatur 45°C nicht überschreitet, innerhalb 30 Minuten 126 ml Phosphoroxychlorid (POCl_3) und anschliessend 57 ml N,N-Dimethylanilin. Das Reaktionsgemisch wird anschliessend während 2 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und dann noch 2 Stunden unter Rückfluss gekocht. Dann wird am Rotationsverdampfer eingeeengt und der Rückstand in 2 l Eis/Wasser zerrieben. Das feste Produkt wird abgenutscht, in 1,5 l Methylenchlorid gelöst, mit Bleicherde behandelt und getrocknet. Nach dem Filtrieren und Einengen der Methylenchlorid-Lösung erhält man einen Rückstand, der sich aus Äthanol umkristallisieren lässt. Man erhält so 51 g kristallines 2-para-Methoxyphenyl-4,6-dichlor-pyrimidin vom Schmelzpunkt 127-128°C.

In analoger Weise zu diesen Beispielen werden folgende Verbindungen hergestellt:



No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
1	(H) ₅	Cl	H	Cl	Smp. 95-96°
2	4-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 86-87°
3	4-CH ₃	Cl	CH ₃	Cl	Smp. 153-154°
4	4-CH ₃	Cl		Cl	Smp. 132-133°
5	(H) ₅	Cl	H	CH ₃	Smp. 71-72°
6	4-CH ₃	Cl	H	CH ₃	Smp. 103-104°
7	4-CH ₃	Cl	H	OH	Smp. 229-234°
8	4-CH ₃	Cl	H	OCH ₃	Smp. 92-93°
9	4-CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	Smp. 143-144°
10	4-CH ₃	Cl	H	OC ₃ H ₇ iso	Smp. 55-57°
11	4-CH ₃	Cl	H		Smp. 86-87°
12	4-CH ₃	Cl	H		Smp. 102-104°
13	4-CH ₃	Cl	H	NHCH ₃	Smp. 107°
14	4-CH ₃	Cl	Br	NHCH ₃	Smp. 105-107°
15	4-CH ₃	Cl	H	N(C ₂ H ₅) ₂	Smp. 74-75°
16	(H) ₅	CH ₃	H	OH	Oel
17	4-CH ₃	CH ₃	H	OH	Smp. 206-207°
18	(H) ₅	CH ₃	H	OCH ₃	Sdp. 156-8°/ ₃ 1.33·10 ³ Pa
19	4-CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	Smp. 66-67°

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
20	4-CH ₃	CH ₃	H		Smp. 90-91°
21	(H) ₅	CH ₃	H	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Sdp. 158-160°/ 13.33 Pa
22	(H) ₅	CH ₃	H	(OC ₂ H ₄) ₂ OCH ₃	Sdp. 148-150°/ 2.66 Pa
23	4-CH ₃	CH ₃	H	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Smp. 61-62°
24	(H) ₅	CH ₃	H	N(CH ₃) ₂	Smp. 55-57°
25	4-CH ₃	CH ₃	H	N(CH ₃) ₂	Smp. 97-98°
26	4-CH ₃	CH ₃	Br	N(CH ₃) ₂	Smp. 49-50°
27	(H) ₅	CH ₃	H		Smp. 88-90°
28	4-CH ₃	CH ₃	H		Smp. 123-124°
29	4-CH ₃	CH ₃	Br		Smp. 113-114°
30	4-CH ₃	OCH ₃	H		Smp. 99-100°
31	4-CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃	Smp. 61-62°
32	4-CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Smp. 93-94°
33	4-CH ₃	OCH ₃		OCH ₃	Smp. 214°
34	4-CH ₃	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	Smp. 71°
35	4-CH ₃	OC ₃ H ₇ ⁿ	H	OC ₃ H ₇ ⁿ	Smp. 62°
36	4-CH ₃	OC ₃ H ₇ ^{iso}	H	OC ₃ H ₇ ^{iso}	Sdp. 123°/5.332 Pa
37	4-CH ₃	OC ₃ H ₇ ^{iso}	Br	OC ₃ H ₇ ^{iso}	Beispiel 1 Smp. 73-74° Beispiel 2
38	4-CH ₃	OC ₄ H ₉ ⁿ	H	OC ₄ H ₉ ⁿ	Sdp. 158-161°/ 13.332 Pa
39	4-CH ₃		H		Smp. 125-126°



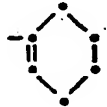

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
40	4-CH ₃	SC ₂ H ₅	H	SC ₂ H ₅	Smp. 55-56°
41	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Oel
42	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Oel
43	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Cl	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Smp. 55-57°
44	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Br	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Smp. 55-56°
45	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	NHCH ₃	Smp. 65-66°
46	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Br	NHCH ₃	Oel
47	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	Oel
48	4-CH ₃		H		Smp. 125-126°
49	4-CH ₃	Br	H	Br	Smp. 125-126°
50	(H) ₅	Br	H	Br	Smp. 115-118°
51	(H) ₅	Cl	H	OH	Smp. 218-221°
52	(H) ₅	Cl	H	SH	Smp. 150° Z
53	4-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 120°
54	4-OCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 127-128°
55	4-CN	Cl	H	Cl	Smp. 230-232°
56	3-CF ₃	Cl	H	Cl	Smp. 56-57°
57	2-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 74-75°
58	2-CH ₃	Cl	Cl	Cl	Smp. 122-125°


No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
59	3-Cl, 4-F	Cl	H	Cl	Smp. 94-95°
60	2,6(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 103-104°
61	3,4(CH ₃) ₂	Br	H	Br	
62	4-C ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl	Smp. 63-64°
63	4-C ₃ H ₇ i	Cl	H	F	
64	4-Cl	F	H	F	Smp. 139-141°
65	2-CH ₃ , 6-C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
66	2-CH ₃ , 6-C ₂ H ₅	Cl	H	C ₂ H ₅	
67	2-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 116-118°
68	3-C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
69	4-CH ₃	Cl	F	Cl	
70	4-F	Cl	F	Cl	
71	3-CHF ₂	Cl	H	Cl	
72	2,4(CH ₃) ₂	Br	H	Br	
73	2,3,6(CH ₃) ₃	Cl	H	Cl	
74	3-C ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl	
75	4-CHF ₂	Cl	H	Cl	
76	2-Cl, 4-CH ₃	Br	H	Br	
77	3,4(Cl) ₂	Cl	H	OH	
78	4-OCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 57-58°
79	4-OH	F	H	F	
80	4-COCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 129-130°
81	4-OCOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
82	4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Cl	H	Cl	
83	4-OCF ₂ Cl	Cl	H	OC ₂ H ₅	
84	4-OH	Cl	H	Cl	Smp. 135-137°
85	4-OCN(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 191-193°
86	3-CH ₂ F	Cl	H	Cl	
87	2-COOCH ₃	Cl	H	OC ₄ H ₉ n	
88	4-CH ₂ F	Cl	H	Cl	
89	4-COOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 135-140°
90	4-COOC ₄ H ₉ n	Cl	H	OC ₄ H ₉ n	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
91	4-Cl, 2,6(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
92	4-CHO	Cl	H	Cl	Smp. 160-162°
93	3-CH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
94	3,5(CF ₃) ₂	Cl	H	Cl	
95	4-CF ₃	Br	H	Br	
96	4-OCHF ₂	Cl	H	Cl	
97	3,5(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
98	4-OC ₃ H ₇ ⁱ	F	H	F	
99	3-NO ₂	Cl	H	Cl	Smp. 136-138°
100	4-NO ₂	Cl	H	Cl	Smp. 167-168°
101	3-NO ₂ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
102	2-Cl, 4-NO ₂	Cl	H	Cl	
103	2-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
104	3-NHCOCH ₃	Br	H	Br	
105	3-NHCOCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
106	4-OCF ₃	Cl	H	OC ₃ H ₇ ⁱ	
107	3-OCF ₂ Cl, 5-Cl	Cl	H	Cl	
108	2-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
109	4-OCF ₂ CHF ₂	Cl	H	Cl	
110	4-CONHC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
111	4-NHCOCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	Smp. 196-198°
112	4-COCH ₃ , 3-CH ₃	Cl	H	CH ₃	
113	3-CH ₂ -COCH ₃	F	H	OCH ₃	
114	4-COC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
115	4-OCF ₂ CHFC1	Cl	H	Cl	
116	2-OH	Cl	H	Cl	
117	4-COOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
118	4-COOCH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	Smp. 105-109°
119	2-Cl, 6-C≡CH	Cl	H	Cl	
120	3-C≡C-C(CH ₃) ₂ OCH ₃	Br	H	Br	
121	4-C≡C-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	Cl	







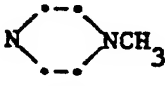
No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
122	4-C≡C-C(CH ₃) ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
123	3,5(I) ₂ , 4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Cl	H	Cl	
124	(H) ₅	Cl	CF ₃	Cl	
125	4-CH=CH-C ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
126	4Cl ₃	Cl	CF ₃	Cl	
127	4-OH	Br	H	Br	
128	4-Br	Cl	H	Cl	Smp. 130-131°
129	3-OH	Cl	H	Cl	Smp. 144-146°
130	3-OCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 97-100°
131	3-OCOCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
132	2-OCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 67-70°
133	2,6(F) ₂	Cl	H	Cl	
134	4-F	Cl	H	Cl	Smp. 102-105°
135	3-Cl, 4-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 91-92°
136	(H) ₅	F	H	F	Smp. 114-116°
137	(H) ₅	F	H	Cl	Smp. 105°
138	2,5(Cl) ₂ , 4-OH	F	H	F	
139	2-Cl, 4-OCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
140	2,3,5(Cl) ₃ , 4-OH	Cl	H	Cl	
141	2,3,5(Cl) ₃ , 4-OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
142	2,3,5,6(CH ₃) ₄ , 4-NO ₂	Cl	H	Cl	
143	(H) ₅	F	CF ₃	Cl	
144	3-SO ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
145	4-CSN(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
146	4-C(CH ₃)=CH ₂	Cl	H	Cl	
147	4-CH ₂ COOCH ₃	Cl	H	Cl	
148	4-CH ₂ PO(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 110-112°
149	4-CH ₂ PO(OH) ₂	Br	H	Br	
150	4-SO ₂ N(CH ₃) ₂ , 5-CH ₃	Cl	H	OC ₄ H ₉ ⁿ	
151	4-PO(OH) ₂	Br	H	Br	
152	4-PO(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
153	3-PO(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	




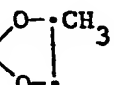
No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
154	H	SOCH ₃	H	Cl	
155	4-CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
156	3-C≡CH, 5-CH ₃	Cl	H	Cl	
157	2-C≡CH	Cl	H	Cl	
158	4-C≡CH	Cl	H	Cl	Smp. 168-170°
159	H	SOCH ₃	H	Br	
160	4-C(OCH ₃) ₂ C ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	OCH ₃	
161	2-CH ₃ , 5-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
162	2-CH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
163	3-Br, 4-OH	Cl	H	OCH ₂ CH=CH ₂	
164	3-Br, 4-OC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
165	3-NO ₂ , 4-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 158-159°
166	3-NH ₂ , 4-Cl	Cl	H	Cl	
167	3-CH ₃ , 4-NO ₂	Cl	H	Cl	Smp. 173-175°
168	3-CH ₃ , 4-NH ₂	Cl	H	Cl	fest
169	3-CH ₃ , 4-NHCON(CH ₃) ₂	F	H	OCH ₂ CH=CH ₂	
170	2-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	Cl	
171	3-CF ₃ , 4-Cl	Cl	H	Cl	
172	4-CH ₃	SOCH ₃	H	Cl	
173	2-Cl, 5-N(CH ₃) ₂	Cl	H	OH	
174	2,6(OCH ₃) ₂ , 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
175	2,6(OCH ₃) ₂ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
176	2,6(OCH ₃) ₂ , 3-NHCOCH ₃	Cl	H	Cl	
177	2-CH ₃ , 6-C ₂ H ₅ , 4-ONCON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
178	3,5(I) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
179	3,5(I) ₂ , 4-OCH ₃	Br	H	Br	
180	3,5(Br) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
181	3,5(Br) ₂ , 4-OCH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
182	3,4,5(OCH ₃) ₃	Cl	H	Cl	Smp. 167-169°
183	2,3(Cl) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 116-118°

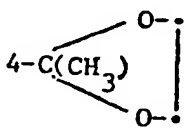
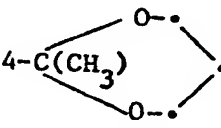


No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
184	4-CH ₃	F	H	SOCH ₃	
185	(H) ₅	SOCH ₃	H	CN	
186	(H) ₅	SCH ₃	H	CN	
187	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	CN	
188	(H) ₅	-O-CO-CH ₃	H	Cl	
189	4-CH ₃	CN	Cl	Cl	
190	3-SO ₂ NHCOONC ₃ H ₇ (i)	Cl	H	Cl	
191	4- 	Cl	H	Cl	
192	3- 	Br	H	Br	
193	3- 	Cl	H	Cl	
194	3-CH ₂ -  -CH ₃	F	H	OCH ₃	
195	3-CF ₃	OH	H	OH	Smp. 286°C
196	4-CH ₃	OCH ₃	H	OH	
197	3-NH ₂	Cl	H	Cl	fest
198	4-NH ₂	Cl	H	Cl	fest
199	3-NHCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 228-230°
200	4-NHCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 190-192°
201	4-SO ₂ NHCOOCH ₃	Cl	H	Cl	
202	3-SO ₂ NCH ₃ COOCH ₃	Cl	H	Cl	
203	4-CH ₃ ·3-SO ₂ H	Cl	H	Cl	
204	4-CH ₃ ·3-SO ₂ NH ₂	Cl	H	Cl	
205	4-NHCONHC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
206	4-Cl, 3-NH ₂	Cl	H	Br	
207	3-I	Cl	H	Cl	
208	3-COOH	Cl	H	Cl	Smp. 250°


No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
209	4-COOH	Cl	H	Cl	Smp. 236-238°
210	3-CH ₃	Cl	H	OH	Smp. 195-200°
211	4-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 150-155°
212	3NHCH ₃	Cl	H	Cl	
213	HNHCH ₃				
214	3-NHCHO				
215	4-NHCHO				
216	3-NHCO 	Cl	H	Cl	
217	4-OCH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
218	4-SCH ₃	Cl	H	F	
219	3-SH	Cl	H	Cl	
220	4-SCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 109-111°
221	4-OCOOCH ₃	Cl	H	F	
222	3-OCOOCH ₃	Cl	H	Cl	
223	3-F	Cl	H	Cl	Smp. 72-74°
224	4-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	Smp. 75-77°
225	4-OC ₂ H ₄ OC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	Wachs
226	4-CH ₂ -CCl=CH ₂	CH ₃	H	Cl	
227	4-SO ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 163-165°
228	4-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	Smp. 42-43°
229	4-OCH ₃	Br	H	Br	Smp. 129-131°
230	-OC ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl	
231	4-OCH ₂ -C=CH	Cl	H	Cl	
232	4-OC ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
233	4-OC ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	
234	4-OC ₂ H ₄ OH	Cl	H	Cl	
235	4-OC ₂ H ₄ SCH ₃	Cl	H	Cl	
236	4-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	Smp. 88-89°
237	4-OCF ₃	Cl	H	Cl	
238	4-OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
239	4-OCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 113-115°
240	4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Cl	H	Cl	




No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
241	4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Br	H	Cl	Smp. 118-120°
242	4-OCOCH=CH ₂	Cl	H	Cl	
243	4-OCOC ₃ H ₆ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
244	4-OCH ₂ CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
245	4-OCH ₂ CH=CHCH ₃	Cl	H	Cl	
246	4-OC ₂ H ₄ CH=CClCH ₃	Cl	H	Cl	
247	(H) ₅	Cl	CHF ₂	Cl	
248	(H) ₅	Cl	H	F	
249	(H) ₅	Cl	H	Br	
250	(H) ₅	J	H	J	
251	4-SOCH ₃	Cl	H	Cl	
252	4-SC ₂ H ₄ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
253	4-SC ₂ H ₄ OCH ₃	Cl	H	Cl	
254	4-SC ₆ H _{13n}	Cl	H	Cl	
255	4-SC ₂ H ₄ COOC ₄ H ₉	Cl	H	Cl	
256	4-SCOCH ₃	Cl	H	Cl	
257	4-SCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
258	4-NH ₂	Br	H	Br	
259	4-NHC ₆ H _{13n}	Cl	H	Cl	
260	4-NHC ₃ H _{7i}	Cl	H	Cl	
261	4-NHCH ₂ COOCH ₃	Cl	H	Br	
262	4-NHCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
263	4-NHCOCH=CH ₂	Cl	H	Cl	
264	4-NHCH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
265	4-N(CH ₂ -CH=CH ₂) ₂	Cl	H	Cl	
266	4-NHCH-C≡CH	Cl	H	Cl	
267	4-NHCH ₂ CH=CHC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
268	4-NH(CH ₂) ₄ C≡CH	Cl	H	Cl	
269	4-NHOCH ₃	Cl	H	Cl	
270	4-NHOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
271	4-N(CH ₃)OCH ₃	Cl	H	Cl	






No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃
272	4-N(CH ₃)COCH ₃	Cl	H	Cl
273	4-B(OCH ₃)COCH ₃	Cl	H	Cl
274	4-NH - 	Cl	H	Cl
275	4-NH - 	Cl	H	Cl
276	4-N 	Cl	H	Cl
277	4-N 	Cl	H	Cl
278	4-N 	Br	H	Br
279	4-N 	Cl	H	Cl
280	4-N 	Cl	H	F
281	4-NHCOOCH ₃	Cl	H	Cl
282	4-N(CH ₃)COOC ₃ H _{7i}	Cl	H	Cl
283	4-NHCONHCH ₃	Cl	H	Cl
284	4-NHCON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
285	4-N(CH ₃)CONHCH ₃	Cl	H	Cl
286	4-N(CH ₃)CON(CH ₃)OCH ₃	Cl	H	Cl
287	COOC ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl
288	4-OCOCH ₂ CH=CHCH ₃	Cl	H	Cl
289	4-CONH ₂	Cl	H	Cl
290	4-CON(C ₃ H ₇ ⁿ) ₂	Cl	H	Cl
291	4-CONHC ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl
292	4-OCOC ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Br	H	Br

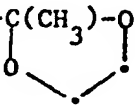


No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃
293	4-CONHOCH ₃	Cl	H	Cl
294	4-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
295	4-CHO	Br	H	Br
296	4-COC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl
297	4-COCH=CH-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
298	4-CSN(C ₃ H ₇) ₂	Cl	H	Cl
299	4-CSNHC ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl
300	4-N=CHC ₃ H ₇ ⁱ	Cl	H	Cl
301	4-N=CHC ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl
302	4-N=CH(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
303	4-N= 	Cl	H	Cl
304	4-N(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl
305	4-SO ₂ NH ₂	Cl	H	Cl
306	4-SO ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
307	4-SO ₂ NHC ₄ H ₉	Cl	H	Cl
308	3-SO ₂ N 	Br	H	Br
309	4-SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl
310	4-CH(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl
311	4-CH(OC ₂ H ₄ OCH ₃) ₂	Cl	H	F
312	4-C(C ₄ H ₉ ⁿ)(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl
313	4-C(CH ₃)(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl
314	4-C(CH ₃)(OC ₂ H ₄ SCCH ₃) ₂	Cl	H	Cl
315	4-CH 	Cl	H	Cl
316	4-CH 	Cl	H	Cl

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
317		Cl	H	Cl	
318		Cl	H	Cl	
319	4-PO(OH)OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
320	4-SO ₃ H	Cl	H	Cl	
321	4-CF ₃	Cl	H	Cl	
322	4-CH ₂ Br	Cl	H	Cl	Smp. 155-156°
323	4-CH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
324	4-CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
325	4-CH ₂ OH	Cl	H	Cl	
326	4-CH ₂ OCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 108-110°
327	4-CH ₂ OC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
328	4-CH ₂ SCH ₃	Cl	H	Cl	
329	4-CH ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
330	4-CHClCH ₃	Cl	H	F	
331	4-C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
332	4-C ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl	
333	4-C ₅ H ₁₁ ^{iso}	Br	H	Br	
334	4-C=CCH ₃	Cl	H	Cl	
335	4-CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
336	4-CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	F	
337	4-CCl=CH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 128-130°
338	4-C ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	
339	4-C ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
340	4- 	Cl	H	Cl	
341	4- 	Cl	H	Cl	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
342	4- 	Cl	H	Cl	
343	4-CH=CH ₂ -CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
344	4-N(CH ₃)COCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
345	4-CH ₂ CN	Cl	H	Cl	Smp. 151-158°
346	3-F	Br	H	Br	
347	3-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 117-119°
348	3-NO ₂	Br	H	Br	Smp. 165-167°
349	3-NO ₂	F	H	F	
350	3-OC ₃ H ₇ ⁱ	Cl	H	Cl	
351	3-OCH ₂ CH=CHCH ₃	Cl	H	F	
352	3-OCH ₂ C=CH	Cl	H	Cl	
353	3-OC ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
354	3-OCH(CH ₃)CH ₂ N(C ₂ H ₅)	Cl	H	Cl	
355	3-OC ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	
356	4-CH ₃	Br	H	Cl	
357	3-OC ₂ H ₄ SC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
358	3-OC ₂ H ₄ OC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
359	3-OCF ₃	Cl	H	F	
360	3-OCHF ₂	Cl	H	Cl	
361	3-OCF ₂ CHF ₂	Cl	H	Cl	
362	3-OCF ₂ CHFC1	Br	H	Br	
363	3-OCOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
364	3-OCOCH ₂ Cl	Br	H	Br	
365	3-SC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
366	3-SCF ₃	Cl	H	Cl	
367	3-SCHF ₂	Cl	H	Cl	
368	3-SO ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	
369	3-SC ₃ H ₆ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
370	3-SC ₃ H ₆ Cl	Cl	H	Cl	
371	3-SC ₅ H ₁₁ ^{iso}	Cl	H	Cl	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
372	3-SCH ₂ COOC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	F	
373	3-S-CH ₂ -C=CH	Cl	H	Cl	
374	3-NH ₂	Br	H	Br	fest
375	3-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
376	3-NHC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
377	3-NHC ₄ H ₉ ^{sek}	Cl	H	Cl	
378	3-N(CH ₂ C=CH) ₂	Cl	H	F	
379	3-NHCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
380	3-N(CH ₃)COCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
381	3-SO ₂ NHCO ₂ CH ₃				Smp. 160-161°
382	3-NHCOCH=CH-CH ₃	Cl	H	Cl	
383	3-NHOH	Br	H	Br	
384	3-NHOC ₂ H ₅	Cl	H	Br	
385	3-NCH ₃ OCH ₃	Cl	H	Cl	
386	3-N(C ₃ H ₇ ^{iso})CO ₂ C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
387	3-N 	Cl	H	Cl	
388	3-N 	Cl	H	Cl	
389	3-NHCOOC ₄ H ₉ ^{iso}	Cl	H	Cl	
390	3-NHCONHC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
391	3-N 	Br	H	Br	
392	3-N(CH ₃)CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
393	3-COOH	Cl	H	Cl	Smp. 250°C
394	3-COOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 190-191°
395	3-COOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 120-121°
396	3-COOC ₃ H ₇ ⁱ	Cl	H	Cl	
397	3-COCH ₂ -C≡C-C ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
398	3-CONH ₂	Cl	H	Cl	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
399	3-CONHOH	Cl	H	Cl	
400	3-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
401	3-CONHCH ₃	Br	H	Br	
402	3-CONHCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	F	
403	3-COOC ₃ H ₆ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
404	3-CHO	Cl	H	Cl	
405	3-COCH ₃	Cl	H	Cl	
406	3-CO- 	Cl	H	Cl	
407	3-CSNHC ₄ H ₉ n	Cl	H	Cl	
408	3-CSNHC ₃ H ₇ iso	Cl	H	Cl	
409	3-CSN 	Cl	H	Cl	
410	3-N=CHC ₃ H ₇ (i)	Cl	H	Cl	
411	3-N=C(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
412	3-N=CHC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
413	3-N=C 	Cl	H	Cl	
414	3-SO ₂ NH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 207-208°
415	3-SO ₂ NHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 174-175°
416	3-SO ₂ N(C ₄ H ₉ n) ₂	Cl	H	Cl	
417	3-SO ₂ N 	Cl	H	Cl	
418	3-SO ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 144-145°
419	3-CH(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
420	3-C(CH ₃)(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
421	3-C(CH ₃)(OC ₂ H ₄ OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
422	3-CH 	Cl	H	Cl	







No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
423	$3-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{O}$ 	Cl	H	Cl	
424	3-PO(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
425	3-P(OH) ₂	Cl	H	Cl	
426	3-P(OH)OCH ₃	Cl	H	Cl	
427	3-SO ₃ H	Cl	H	Cl	Smp. 95-96°
428	3-CF ₃	Cl	H	F	
429	3-CH ₂ CN	Cl	H	Cl	
430	3-CH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
431	3-CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
432	3-CH ₂ OH	Br	H	Br	
433	3-C ₂ H ₄ SCH ₃	Cl	H	Cl	
434	3-C ₂ H ₄ SOCH ₃	Cl	H	Cl	
435	3-CHCl-C ₂ H ₅	Cl	H	F	
436	3-C ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
437	3-C ₆ H ₁₃ ^{iso}	Cl	H	Cl	
438	3-C≡CH	Cl	H	Cl	
439	3-C≡CCH ₃	Cl	H	Cl	
440	3-CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
441	3-CCl=CH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 68-72°
442	3-CCl=CHCH ₃	Cl	H	Cl	
443	3-C ₂ H ₄ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
444	$3-\text{C}$ 	Cl	H	Cl	
445	3-CH=CH-C ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
446	$3-\text{C}$ 	Cl	H	Cl	
447	3-CH ₂ COOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
448	3-CH ₂ CONH ₂	Br	H	Br	
449	2-CH ₃	Br	H	Br	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
450	2-F	Cl	H	Cl	
451	2-OCH ₂ C=CH	Cl	H	Cl	
452	2-SCH ₃	Cl	H	Cl	
453	2-SH	Cl	H	Cl	
454	2-COOH	Cl	H	Cl	
455	2-COOCH ₃	Cl	H	Cl	
456	2-CH ₂ OH	Br	H	Br	
457	2-CHO	Cl	H	Cl	
458	3-Cl, 4F	F	H	F	Smp. 101-103°
459	3-Cl, 4F	F	H	Cl	
460	3,4(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
461	3,5(Cl) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 175-177°
462	2,6(Cl) ₂	Cl	H	Cl	
463	2,3(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
464	2,4(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
465	3-Cl, 4-C ₃ H ₇ iso	Cl	H	Cl	
466	2-Cl, 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
467	3,4(Cl) ₂	Cl	H	Cl	
468	3,5(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 168-172°
469	3-NH ₂ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
470	3-NHCH ₃ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
471	3-OH, 5-Cl	Cl	H	Cl	
472	3-OCHF ₂ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
473	3-OCH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
474	3-COOH, 5-Cl	Cl	H	Cl	
475	3-COOCH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
476	3-CONH ₂ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
477	4-COCH ₃ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
478	2-Cl, 6-C=CH	Br	H	Br	
479	4-SO ₂ N(CH ₃) ₂ , 5-CH ₃	Br	H	Br	
480	3-C=CH, 5CH ₃	Cl	H	F	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
481	2-CH ₃ , 5-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
482	2-CH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
483	3-Br, 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
484	3-CH ₃ , 4-NHCON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
485	2 SCH ₃ , 5-NO ₂	Cl	H	Cl	
486	2 SCH ₃ , 5-NH ₂	Cl	H	Cl	
487	2 Cl, 5-NO ₂	Cl	H	Cl	
488	2 Cl, 5NH ₂	Cl	H	Cl	
489	3,4(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
490	3,4 (OH) ₂	Cl	H	Cl	
491	2,3 - Cl ₂	Cl	H	Cl	Smp. 116-118°
492	2,5 (OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 127-129°
493	2,5 (OH) ₂	Cl	H	Br	
494	4-CN ₃ , 3-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 120-123°
495	4-OH, 3-CH ₃	Cl	H	Br	
496	4-OCH ₃ , 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
497	4-OH, 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
498	4-OCH ₃ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
499	4-OH, 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
500	3,5 (OH) ₂	Cl	H	Cl	
501	2,6 Cl ₂ , 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
502	2,6 Cl ₂ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
503	2,6(OCH ₃) ₂ , 4-Cl	Br	H	Br	
504	2,6(OH) ₂ , 4-Cl	Br	H	Br	
505	3,5(J) ₂ , 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
506	3,5(J) ₂ , 4-OH	Br	H	Br	
507	3,5(Cl) ₂ , 4-OCH ₃	Br	H	Br	
508	3,5(Cl) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
509	2,5(Cl ₂), 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
510	2,5(Cl) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
511	4F	Cl	H	Br	
512	3,4(OH) ₂	Br	H	Br	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
513	2,6(OH) ₂ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
514	3-OCH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
515	3,5(OH) ₂ , 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
516	3,4,5(OH) ₃	Cl	H	Cl	
517	2,3,4(OCH ₃) ₃	Cl	H	Cl	
518	2,3,4(OH) ₃	Cl	H	Cl	
519	2,3,5(Cl) ₃ , 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
520	(CH ₃) ₅	Cl	H	Cl	
521	H	CN	H	CN	Smp. 150-155°
522	H	Cl	H	CN	
523	4-CH ₃	CN	H	CN	
524	4-CH ₃	Cl	H	CN	
525	4-OCH ₃	CN	H	CN	
526	4-OCH	CN	H	Cl	
527	4-OH	CN	H	CN	
528	4-OH	Cl	H	CN	Smp. 69-72°
529	(H) ₅	SCH ₃	H	Cl	
530	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	Cl	
531	(H) ₅	SCH ₃	H	Br	
532	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	Br	
533	(H) ₅	SCH ₃	H	F	
534	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	F	
535	(H) ₅	CN	Cl	Cl	
536	3-SCH ₂ CO ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	
537	(H) ₅	OCF ₃	H	Cl	
538	4-CH ₃	OCF ₃	H	Cl	
539	4-CH ₃	OCOCH ₃	H	Cl	Smp. 110-112°
540	4-OH, 3CH ₃	Cl	H	Cl	
541	(H) ₅	Cl	F	Cl	
542	(H) ₅	Br	F	Br	
543	3-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 76-79°
544	3-SCH ₃	Cl	H	Cl	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
545	3-CCl ₃	Cl	H	Cl	
546	4-CCl ₃	Cl	H	Cl	
547	4-OH, 3-CH ₃	Br	H	Cl	Smp. 140-145°
548	4-SCH ₂ COCH ₃	Cl	H	Cl	
549	3-SCOH=CH ₂	Cl	H	Cl	
550	4-SCOH=CHCH ₃	Cl	H	Cl	
551	3-SCO-CH ₂ C≡CH	Br	H	Br	
552	4-SOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
553	3-SOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
554	4-SOCH ₂ C≡CH	F	H	Cl	
555	3-SOCH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	
556	3-SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Br	H	Br	
557	4-SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
558	3-SO ₂ CH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	
559	4-SO ₂ CH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	
560	4-OCOC ₆ H _{13n}	Cl	H	Cl	
561	3-OCO-C ₅ H ₁₁ i	Cl	H	Cl	
562	4-CONHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 205-209°
563	3-CONHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 134-137°
564	4-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 191-193°
565	4-CONHC ₄ H ₉	Cl	H	Cl	
566	3-CONHC ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl	
567	4-OCOCH=CH ₂	Cl	H	Cl	
568	3-OCOCH=CH-CH ₃	Cl	H	Cl	
569	4-OCOCH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
570	3-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
571	4-NHCONHC ₄ H ₉ n	Cl	H	Cl	
572	4-SH	Cl	H	Cl	
573	3-OC ₂ H ₄ OH	Cl	H	Cl	
574	3-NHC ₂ H ₄ COOCH ₃	Cl	H	Cl	
575	3-Br, 4-OH	Cl	H	Cl	
576	3-NHCONHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 234-238°
577	4-OCH ₃	OH	H	OH	Smp. 318° Z

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	
577	4-Br	Cl	H	CH ₃	Smp. 143-146°
578	4-CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	Smp. 138-139°
579	4-CH ₃	OH	H	OH	Smp. 311° Z
580	4-CH ₃	OH	H	SO ₃ CH ₃	Smp. 96-99°
581	4-OCH ₂ CH=CH ₂	OH	H	OH	Smp. 280° Z
582	4-F	OH	H	OH	Smp. 330° Z
583	3-OH	OH	H	OH	Smp. 320° Z
584	4-O- 	OH	H	OH	Smp. 250° Z
585	3,4-OCH ₂ O-	Cl	H	Cl	Smp. 148-150°
586	4-OC ₃ H ₆ O- 	Cl	H	Cl	Smp. 102-103°
587	3-O- 	Cl	H	Cl	Smp. 91-93°
588	(H) ₅	OH	H	CH ₂ Cl	Smp. 193-195°
589	-N(C ₂ H ₄ OH) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 169-171°
590	- 	Cl	H	-ON=C(-CH ₃) ₂	Smp. 120-121°
591	3-COCH ₃	OH	H	OH	Smp. 230° Z
592	3,4 Cl ₂ 5-P(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 220° Z
593	-OCON(CH ₃)OCH ₃	Cl	H	Br	Smp. 170-172°
594	-N=CH- 	Cl	H	Cl	Smp. 152-154°
595	-OCONH-  -Cl	Cl	H	Cl	Smp. 195-198°

Die Verbindungen der Formel I werden im allgemeinen nicht als solche in der Landwirtschaft eingesetzt. Man verwendet gebrauchsfertige formulierte Mittel, in denen die aktiven Verbindungen mit Trägerstoffen, Netzmitteln und anderen in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsstoffen vermischt vorliegen, so dass sie entweder direkt oder mit Wasser verdünnt eingesetzt werden können. Die Herstellung solcher Mittel kann beispielsweise den folgenden Beispielen entnommen werden.

Beispiel 8: Stäubemittel

Zur Herstellung eines a) 5Zigen und b) 2Zigen Stäubemittels werden die folgenden Stoffe verwendet:

- a) 5 Teile 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropoxy-pyrimidin
95 Teile Talkum,
- b) 2 Teile des obigen Wirkstoffes oder einer Mischung,
1 Teil hochdisperse Kieselsäure,
97 Teile Talkum.

Die Wirkstoffe werden mit den Trägerstoffen vermischt und vermahlen und können in dieser Form zur Anwendung verstäubt werden.

Beispiel 9: Granulat

Zur Herstellung eines 5Zigen Granulates werden die folgenden Stoffe verwendet:

- 5 Teile 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropoxy-5-brom-pyrimidin
- 0,25 Teile epoxidiertes Pflanzenöl,
- 0,25 Teile Cetylpolyglykoläther,
- 3,50 Teile Polyäthylenglykol,
- 91 Teile Kaolin (Korngrösse 0,3-0,8 mm).

Die Aktivsubstanz oder die Mischung wird mit dem Pflanzenöl vermischt und mit 6 Teilen Aceton gelöst, hierauf wird Polyäthylenglykol und Cetylpolyglykoläther zugesetzt. Die so erhaltene Lösung wird auf Kaolin aufgesprüht, und anschliessend wird das Aceton im Vakuum verdampft. Ein derartiges Mikrogranulat lässt sich vorteilhaft in Saatzfurchen einarbeiten.

Beispiel 10: Spritzpulver

Zur Herstellung eines a) 70%igen, b) 40%igen, c) und d) 25%igen, e) 10%igen Spritzpulvers werden folgende Bestandteile verwendet:

- a) 70 Teile 2-para-Tolyl-4,6-bis-(methoxyäthyl)-5-chlorpyrimidin
- 5 Teile Natriumdibutyl-naphthylsulfonat,
- 3 Teile Naphthalinsulfonsäuren-Phenolsulfonsäuren-Formaldehyd-Kondensat 3:2:1,
- 10 Teile Kaolin,
- 12 Teile Champagne-Kreide;
- b) 40 Teile Wirkstoff
- 5 Teile Ligninsulfonsäure-Natriumsalz,
- 1 Teil Dibutyl-naphthalinsulfonsäure-Natriumsalz,
- 54 Teile Kieselsäure;
- c) 25 Teile Wirkstoff
- 4,5 Teile Calcium-Ligninsulfonat,
- 1,9 Teile Champagne-Kreide/Hydrixyäthylcellulose-Gemisch (1:1),
- 1,5 Teile Natrium-dibutyl-naphthalinsulfonat,
- 19,5 Teile Kieselsäure,
- 19,5 Teile Champagne-Kreide,
- 28,1 Teile Kaolin;
- d) 25 Teile Wirkstoff
- 2,5 Teile Isooctylphenoxy-polyoxyäthylenäthanol,

- 1,7 Teile Champagne-Kreide/Hydroxyäthylcellulose-Gemisch (1:1),
- 8,3 Teile Natriumaluminiumsilkat,
- 16,5 Teile Kieselgur,
- 46 Teile Kaolin;
- e) 10 Teile Wirkstoff oder Mischung,
- 3 Teile Gemisch der Natriumsalze von gesättigten Fettalkohol-sulfaten,
- 5 Teile Naphthalinsulfonsäure/Formaldehyd-Kondensat,
- 82 Teile Kaolin.

Die Wirkstoffe werden in geeigneten Mischern mit den Zuschlagstoffen innig vermischt und auf entsprechenden Mühlen und Walzen vermahlen. Man erhält Spritzpulver von vorzüglicher Benetzbarkeit und Schwebefähigkeit, die sich mit Wasser zu Suspensionen der gewünschten Konzentration verdünnen und insbesondere zur Blattapplikation (zwecks Wuchsverzögerung ...) verwenden lassen.

Beispiel 11: Emulgierbare Konzentrate

Zur Herstellung eines 25%igen emulgierbaren Konzentrates werden folgende Stoffe verwendet:

- 25 Teile 2-Phenyl-4-chlor-6-methyl-pyrimidin
- 10 Teile eines Alkylarylsulfonat/Fettalkoholpolyglykoläther-Gemisches,
- 5 Teile Dimethylformamid,
- 57,5 Teile Xylol.

Beispiel 12: Paste

Zur Herstellung einer 45%igen Paste werden folgende Stoffe verwendet:

- a) 45 Teile 2-Phenyl-4-chlor-6-hydroxy-pyrimidin oder einer Mischung davon mit 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(methoxymethyl)-acetanilid,

- 5 Teile Natriumaluminiumsilikat,
- 14 Teile Cetylpolyäthylenglykoläther mit 8 Mol Äthylenoxid,
- 1 Teil Oleylpolyäthylenglykoläther mit 5 Mol Äthylenoxid,
- 2 Teile Spindelöl,
- 23 Teile Wasser,
- 10 Teile Polyäthylenglykol;
- b) 45 Teile des obigen Wirkstoffes oder der Mischung,
- 5 Teile Äthylenglykol,
- 3 Teile Octylphenoxypolyäthylenglykol mit 9-10 Mol Äthylenoxid
pro Mol Octylphenol,
- 3 Teile von einem Gemisch aromatischer Sulfonsulfosäuren,
kondensiert mit Formaldehyd als Ammoniumsalz,
- 1 Teil Siliconöl in Form einer 75%igen Emulsion,
- 0,1 Teile einer Mischung von 1-(3-Chlorallyl)-3m5m7-triazo-
azonium-adamantan-chlorid mit Natriumcarbonat,
Chloridwert mind. 11,5%,
- 0,2 Teile eines biopolymeren Verdickers mit max. 100 Keimen
pro Gramm,
- 42,7 Teile Wasser.

Die Aktivsubstanz wird mit den Zuschlagstoffen in dazu geeigneten Geräten innig vermischt und vermahlen. Man erhält eine Paste, aus der sich durch Verdünnen mit Wasser Suspensionen jeder gewünschten Konzentration herstellen lassen.

Biologische Beispiele:

Die Fähigkeit der 2-Phenylpyrimidine das Pflanzenwachstum zu regulieren, respektive den Pflanzenmetabolismus zu beeinflussen kann aus den folgenden Beispielen ersehen werden.

Beispiel 13:

Wuchshemmung Solanum und Avena

In Kunststofftöpfen mit sterilisierter Erde werden die Pflanzen Solanum (Tomate) und Avena sativa (Kulturhafer) angesät und im Gewächshaus angezogen. Bewässerung, Temperaturregelung und Beleuchtung erfolgte nach Bedarf. Zwei Wochen nach Ansaat erfolgte die Applikation mit 4 kg Wirkstoff pro Hektar mit einer Brühe welche durch Verdünnen eines 25%igen Emulsionskonzentrates mit einer Wassermenge von 500 Liter/ha erhältlich wurden. Zwei Wochen nach der Applikation wird das Pflanzenwachstum beurteilt. Die Wuchshöhe wird gemessen und in % zur Kontrolle ausgedrückt (K = 100%). Die folgenden Nebenwirkungen werden bestimmt:

- X = leichte Nekrose
- Y = starke Nekrose
- L = leichte Chlorose
- C = starke Chlorose
- B = Blattdeformation

Die Resultate sind wie folgt:

Verbindung No.	Solanum		Avena	
	% Wuchshöhe	Nebenwirkung	% Wuchshöhe	Nebenwirkung
13	0	Y	100	-
14	65	L X	100	-
15	40	L X	100	-
41	40	L X	100	-
53	100	-	75	X
54	100	-	75	X
67	15	L B	100	-
70	65	L X B	100	-
441	65	B X	100	-
529	65	C	100	-
557	50	-	100	-
578	0	Y	100	-
579	75	X	100	-
581	15	L X B	85	-
586	40	B Y	100	-
592	65	-	100	-

Beispiel 14:

Wurzelwachstum (30 Tage-Versuch)

Zur Untersuchung des Wurzelwachstums erfolgte die Kultur in mit Erde gefüllten Kisten (60 x 40 x 80 cm) für Saatbehandlungen und in mit Erde gefüllten Röhren (10 x 100 cm) für Post-Applikationen.

Die Produkte werden als Saatbeizungen (45-500 mg pro kg Samen) oder direkt nach der Saat als Bodenbehandlungen (0.1-1.0 kg/ha) oder 2 Wochen nach Ansaat als Post-Applikation (0.3-3.0 kg/ha) als verdünnte wässrige Emulsion appliziert.

Für die Kultur werden die Gefäße in Klimakammern unter kontrollierten Bedingungen gehalten.

Die Bewertung der Wurzeln erfolgt 30 Tage nach Applikation, nachdem die Erde vorsichtig ausgewaschen wurde.

Wurzellänge und Wurzelgewicht werden bestimmt und in % zur unbehandelten Kontrolle ausgedrückt (= 100%).

Die Resultate sind wie folgt:

Verbindung No.	Kultur	Applikation	Wurzellänge %	Wurzelgewicht %
1	Weizen	Saatbeizung mg/kg Saat		
		45	103	106
		150	106	97
		500	106	111
1	Soja	45	97	123
		150	102	110
		500	95	95
1	Weizen	Post-Applikation kg/ha		
		0,1	108	117
		0,3	91	117
		1,0	99	91
200	Weizen	0,3	120	112
		1,0	110	116
		3,0	110	120
200	Baum- wolle	Bodenbehandlung kg/ha		
		0,1	113	115
		0,3	111	115
		1,0	105	104
	Weizen	0,1	101	117
		0,3	98	116
		1,0	98	119

Beispiel 15:

Wurzelwachstum (10-Tage Versuch)

Zur Untersuchung des Wurzelwachstums erfolgt die Kultur in mit Erde gefüllten Plastikzylindern (5 x 30 cm).

Die Produkte werden als Saatbeizung (13-150 mg/kg Samen) oder direkt nach der Saat als Bodenbehandlung (soil drench) (0.1-10 kg/ha) als verdünnte wässrige Emulsionen appliziert.

Nach der Ansaat (10 Samen/Zylinder) werden die Zylinder in Klimakammern unter kontrollierten Bedingungen gehalten.

Die Bewertung der Wurzeln erfolgt 10 Tage nach Ansaat nachdem die Erde vorsichtig ausgewaschen wurde.

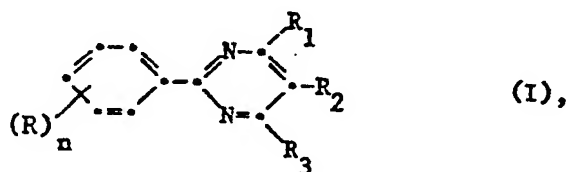
Gemessen werden die Wurzellänge und das Wurzeltrockengewicht. Der Ausdruck der Resultate erfolgt in % zur unbehandelten Kontrolle (= 100%).

Die Ergebnisse sind wie folgt:

Verbindung No.	Kultur	Applikation	Wurzellänge %	Wurzelgewicht %
1	Weizen	Samenbeizung mg/kg Saat		
		13	105	118
		45	101	118
2	Weizen	150	106	126
		13	101	90
		45	103	105
18	Weizen	150	114	95
		13	95	110
		45	96	110
31	Weizen	150	91	98
		13	111	100
		45	106	86
200	Baumwolle	150	109	93
		Bodenbehandlung kg/ha		
		0,1	113	115
		0,3	111	115
		1,0	105	104


Patentansprüche:

1. Verfahren zur Regulierung des Pflanzenwachstums, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pflanzen, deren Samen oder Anbaufläche mit einer wirksamen Menge eines Phenylpyrimidins der Formel I behandelt



worin

n eine Zahl von 1 bis 5,

R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, $-XR_5$, $-NR_6R_7$, $-CO-A$, $-CS-NR_6R_7$, $-SO_2-NR_6R_7$, $C(OR_4)_2-R_4$, , $-PO(OR_4)_2$, $-SO_3H$, $-N=CR_8R_9$, eine

unsubstituierte oder durch Halogen, $-XR_5$, $-NR_6R_7$, $-PO(OR_4)_2$, $-CO-A$ oder Cyan substituierte C_1-C_6 -Alkyl- oder C_3-C_6 -Cycloalkylgruppe oder eine unsubstituierte oder durch Halogen oder $-XR_4$ substituierte C_2-C_6 -Alkenyl-, C_3-C_6 -Cycloalkyl- oder C_3-C_6 -Alkinylgruppe,

R_1 und R_3 unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, Cyan, $-CO-A$, $-NR_6R_7$, $-XR_5$ oder unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, Nitro oder $-XR_5$ substituiertes Phenyl,

R_2 Wasserstoff, Halogen, unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, Trifluormethyl, Nitro oder $-XR_5$ substituiertes Phenyl oder eine unsubstituierte oder durch Halogen oder $-XR_5$ substituierte C_1-C_6 -Alkyl-, C_3-C_6 -Cycloalkyl-, C_2-C_6 -Alkenyl- oder C_2-C_6 -Alkinylgruppe,

R_4 Wasserstoff, eine unsubstituierte oder durch Halogen, $-CO-A$, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy oder $-NR_6R_7$ substituierte C_1-C_6 -Alkyl- oder C_3-C_6 -Alkenyl- oder C_2-C_6 -Alkinylgruppe,

R_5 dasselbe wie R_4 , ausserdem C_1-C_6 -Alkylcarbonyl, C_3-C_6 -Alkenylcarbonyl, C_3-C_6 -Alkinylcarbonyl,

R_6 und R_7 unabhängig voneinander je Wasserstoff, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder unsubstituiertes oder durch -CO-A substituiertes C_1-C_6 Alkyl, oder einer der Reste R_6 und R_7 bedeutet eine Gruppe -COA oder -OR₄ oder

R_6 und R_7 zusammen eine 4- bis 6-gliedrige Alkylenkette, die durch Sauerstoff, Schwefel, eine Imino- oder C_1-C_4 -Alkylaminogruppe unterbrochen sein kann,

B eine verzweigte oder unverzweigte C_1-C_6 -Alkylenkette und

X Sauerstoff, Schwefel, -SO- oder -SO₂- bedeuten,

A die gleiche Bedeutung wie R_4 hat oder für -OR₄ oder -NR₆R₇ steht,

R_8 unsubstituiertes oder durch C_1-C_6 -Alkoxy substituiertes Alkyl,

R_9 Wasserstoff oder dasselbe wie R_8 oder

R_8 und R_9 zusammen eine 4-5-gliedrige Alkylenkette bedeuten.

2. Verfahren gemäss Anspruch 1 dadurch gekennzeichnet, dass man die Pflanzen, deren Samen oder Anbaufläche mit einer wirksamen Menge eines Phenylpyrimidines der Formel I behandelt, worin n eine Zahl von 1 bis 3,

R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Cyanoalkyl, Hydroxy, (C_1-C_4 -Alkoxy)_n, C_1-C_4 -Halogenalkoxy

C_2-C_8 -Halogenalkoxyalkyl, C_2-C_4 -Alkenyl, C_2-C_4 -Halogenalkenyl, C_2-C_4 -Alkenyloxy, C_2-C_4 -Alkynyl, Sulfhydryl, C_1-C_4 -Alkylthio, Carboxyl,

C_1-C_4 -Alkylcarbonyl, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl, C_2-C_4 -Alkenylcarbonyl,

C_2-C_4 -Alkynylcarbonyl, C_1-C_4 -Alkylcarbonyl- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -Alkyl-

carbonyloxy, C_1-C_4 -Alkylaminocarbonyl, C_1-C_4 -Dialkylaminocarbonyl,

Amino, C_1-C_4 -Alkylamino, C_1-C_4 -Dialkylamino, Acetyl-amino, Chloracetyl-

amino, Methylureido, Dimethylureido, Sulfonyl, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl,

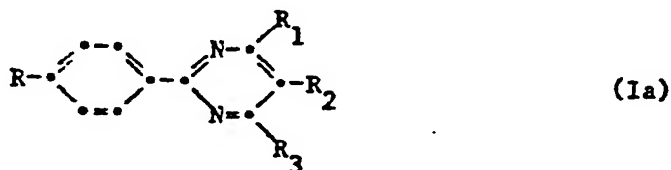
Sulfamoyl, C_1-C_4 -Alkylsulfamoyl, C_1-C_4 -Dialkylsulfamoyl, C_1-C_4 -Alkoxy-

carbonylsulfamoyl, C_1-C_4 -Dialkoxyphosphonylmethyl

R_1 und R_3 unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl,

Cyan, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_8 -Alkoxyalkyl, Phenyl, Phenoxy, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyloxy, Amino, C_1-C_4 -Alkylamino, C_1-C_4 -Dialkylamino, Morpholino, Sulfhydryl und R_3 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl oder Phenyl bedeuten.

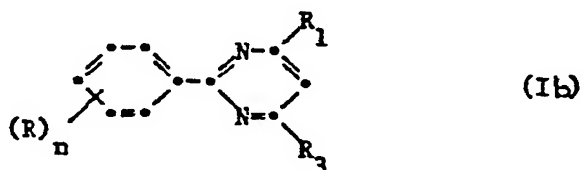
3. Verfahren gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pflanzen, deren Samen oder Anbaufläche mit einer wirksamen Menge eines Phenylpyrimidins der Formel Ia behandelt,



worin R Wasserstoff oder Methyl

R_1 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_8 -Alkoxyalkyl, Phenyl, Phenoxy, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyloxy, Amino, C_1-C_4 -Alkylamino, C_1-C_4 -Dialkylamino, Morpholino oder Sulfhydryl, R_2 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl oder Phenyl, R_3 Halogen, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_8 -Alkoxyalkyl, Phenoxy oder Sulfhydryl bedeuten.

4. Verfahren gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pflanzen, deren Samen oder Anbaufläche mit einer wirksamen Menge eines Phenylpyrimidins der Formel Ib behandelt



worin n, R, R_1 und R_3 die im Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben.

5. Verfahren gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pflanzen, deren Samen oder Anbaufläche mit einer wirksamen Menge 2-Phenyl-4,6-dichlorpyrimidins behandelt.
 6. Verfahren gemäss Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pflanzen, deren Samen oder Anbaufläche mit einer wirksamen Menge 2-(4-Methoxycarbonylamidophenyl)-4,6-dichloropyrimidin behandelt.
 7. Verfahren gemäss Anspruch 1 zur Wuchshemmung im Sinne einer Erhöhung der Knickfestigkeit und Halmverkürzung bei den Getreidesorten Hafer, Weizen, Gerste oder Roggen.
 8. Verfahren gemäss Anspruch 1 zur Wuchshemmung bei Gräsern und Unkräutern.
 9. Verfahren gemäss Anspruch 1 zur Wuchsregulierung bei Soja im Sinne einer Ertragssteigerung.
 10. Verfahren gemäss Anspruch 1 zur Wuchshemmung von Bodenbedeckerpflanzen.
 11. Verfahren gemäss Anspruch 1 zur Wuchsregulierung von Baumwollpflanzen im Sinne einer Ertragssteigerung.
 12. Verfahren gemäss Anspruch 1 zur Wuchsregulierung bei Getreidepflanzen im Sinne einer Ertragssteigerung.
 13. Verfahren gemäss Anspruch 1 zur Stimulierung des Wurzelwachstums von keimenden Nutzpflanzen.
 14. Die Verwendung der Phenylpyrimidine der Formel I zur Regulierung des Pflanzenwachstums, dadurch gekennzeichnet, dass man eine gemäss Anspruch 1 definierte Verbindung in einer wirksamen Menge auf die Samen, die Pflanze oder deren Standort appliziert.
- FO 7.5 NU/rn*/cw*

THIS PAGE BLANK (USPTO)

(19)



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

(11) Veröffentlichungsnummer:

0 136 976
A3

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 84810408.9

(51) Int. Cl.: **A 01 N 43/54**

(22) Anmeldetag: 20.08.84

(30) Priorität: 23.08.83 CH 4614/83

(71) Anmelder: CIBA-GEIGY AG, Postfach, CH-4002 Basel (CH)

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung: 10.04.85 Patentblatt 85/15

(84) Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE FR GB IT LI NL

(88) Veröffentlichungstag des später veröffentlichten Recherchenberichts: 15.05.85 Patentblatt 85/20

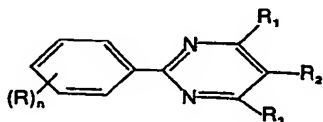
(72) Erfinder: Seiler, Alfred, Dr., Schulstrasse 14, CH-4332 Stein (CH)
Erfinder: Müller, Urs, Dr., Drosselstrasse 6, CH-4142 Münchenstein (CH)

(54) Verwendung von Phenylpyrimidinen als Pflanzenregulatoren.

(57) Phenylpyrimidine der unten definierten Formel I eignen sich zur Regulierung des Pflanzenwuchses. Sie können für verschiedene Zwecke verwendet werden, wie z. B. Massnahmen, die mit der Ertragssteigerung von Nutzpflanzen, Ernteerleichterung und Arbeitseinsparung, ferner Erhöhung der Knick- und Wetterfestigkeit der Pflanzen im Zusammenhang stehen. Die Phenylpyrimidine entsprechen der Formel

oxycarbonyloxy, Amino, Alkylamino, Morpholino oder Sulfhydryl und

R₂ Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl oder Phenyl bedeuten.



(I),

worin R Wasserstoff, Halogen, Nitro Cyan gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Hydroxy gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Sulfhydryl, Alkylthio, Carboxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Amino, Alkylamino, Acetylamino, Ureido, Sulfonyl, Alkylsulfonyl, Sulfamoyl, Alkylsulfamoyl oder Alkoxyphosphonylmethyl,

R₁ und R₂ unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, Alkyl, Cyan, Hydroxy, Alkoxy, Alkoxyalkoxy, Alk-

ACTORUM AG

EP 0 136 976 A3



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

0136976
Nummer der Anmeldung

EP 84 81 0408

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl. 4)
D, X	EP-A-0 055 693 (CIBA-GEIGY) * Seite 3, Zeile 13 - Seite 7, Zeile 27; Ansprüche 1-7, 38-54, 64-66 *	1-14	A 01 N 43/54
X	DE-A-2 734 827 (I.C.I.) * Ansprüche 1,3-6,9-14; Seite 20, Verbindungen 97-100; Seite 23, Zeile 16 - Seite 24, Zeile 15 *	1-4, 7-14	
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int. Cl. 4)
			A 01 N
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt.			
Recherchenort DEN HAAG		Abschlußdatum der Recherche 04-01-1985	Prüfer FLETCHER A.S.
<p>EPA Form 1503 03 82</p> <p>KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN</p> <p>X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : nichtschriftliche Offenbarung P : Zwischenliteratur T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze</p> <p>E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus andern Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument</p>			

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)